

Title (en)

HETEROBIFUNCTIONAL REAGENTS AND CONJUGATES WITH OXAALKYLENE UNITS FOR AMPHIPHILIC BRIDGE STRUCTURES.

Title (de)

HETEROBIFUNKTIONELLE REAGENTIEN UND KONJUGATE MIT OXAALKYLEN-EINHEITEN FÜR AMPHIPHILE BRÜCKENSTRUKTUREN.

Title (fr)

REACTIFS HETEROBIFONCTIONNELS ET CONJUGUES AVEC UNITES D'OXA-ALKYLENE POUR DES STRUCTURES DE PONTAGE AMPHIPHILES.

Publication

EP 0540612 A1 19930512 (EN)

Application

EP 91913626 A 19910716

Priority

- SE 9002484 A 19900720
- SE 9002490 A 19900720

Abstract (en)

[origin: WO9201474A1] A conjugate substance (A-B-A'), where A and A' are residues from organic compounds F and F'; at least one of which being a polymer (carrier) and said compounds having properties that are retained in the conjugate and -B- being a bridge that covalently binds A to A'. The bridge -B- comprises the structure -SrRCONHCH₂CH₂(OCH₂CH₂)_nO(CH₂)_mCOY- (I); (i) n is often an integer 1-20 that is uniform for bridges linking identically located positions in individual molecules of the substance; (ii) m = 1 or 2; (iii) R = an alkylene group (1-4 carbon atoms) that possibly is substituted with one or more (1-3) hydroxy(OH) groups; (iv) = sulfur in the form of a thioether (r = 1) or disulfide (r = 2), and Sr binding to saturated carbon atoms in both directions; (v) Y is -NH-, -NHNH- or -NHN=CH- that in their left ends bind to CO and in their right ends to saturated carbon atom or to a carbonyl group (only -NHNH-). A bifunctional coupling reagent complying with the formula Z1RCONHCH₂CH₂(OCH₂CH₂)_nO(CH₂)_mZ'1 (III); (i) n is an integer, often 1-20; (ii) m is an integer 1 or 2, preferably 1; (iii) Z1 = a SH-reactive electrophile or thiol (SH-) or protected thiol; (iv) R = an alkylene group (1-4 carbon atoms, that possibly is substituted with one or more (1-3) hydroxy(OH) groups; and (v) Z'1 is activated carboxy. A polyether complying with the formula XCH₂CH₂(OCH₂CH₂)_nOCH₂Y (IV) where n is an integer 2-20, preferably 3-10. X is H₂N- or substituted H₂N- that is transformable to H₂N-, preferably by hydrolysis or reduction. Y is carboxy or a group that is transformable to carboxy.

Abstract (fr)

Substance de conjugué (A-B-A'), dans laquelle A et A' sont des restes de composés organiques F et F'; l'un d'eux au moins est un polymère (porteur) et lesdits composés ont des propriétés qui sont conservées dans le conjugué, et -B- est un pont qui lie par covalence A à A'. Le pont -B- comprend la structure -SrRCONHCH₂CH₂(OCH₂CH₂)_nO(CH₂)_mCOY- (I); (i) n est souvent un nombre entier compris entre 1 et 20 qui est uniforme pour des ponts effectuant la liaison de position située de manière identique dans des molécules individuelles de la substance; (ii) m est égal à 1 ou 2; (iii) R est un groupe alkylène (1 à 4 atomes de carbone) qui peut être substitué par 1 ou plusieurs (1-3) groupes hydroxy (OH); (iv) = soufre sous la forme d'un thio-éther (r=1) ou bisulfure (r=2), et Sr se liant à des atomes de carbone saturés dans les deux directions; (v) Y représente -NH-, -NHNH- ou -NHN=CH- qui, dans leurs extrémités de gauche se lient à CO et dans leurs extrémités de droite se lient à un atome de carbone saturé ou à un groupe carbonyle (uniquement -NHNH-). Un réactif de couplage bifonctionnel ayant la formule Z1RCONHCH₂CH₂(OCH₂CH₂)_nO(CH₂)_mZ'1 (III); (i) n est un nombre entier souvent compris entre 1 et 20; (ii) m est un nombre entier égal à 1 ou 2, de préférence 1; (iii) Z1 est un thiol ou électrophile réagissant à SH (SH-) ou un thiol protégé; (iv) R est un groupe alkylène (1 à 4 atomes de carbone) qui est éventuellement substitué par un ou plusieurs (1-3) groupes hydroxy (OH); et (v) Z'1 est un carboxy activé. Un polyéther ayant la formule XCH₂CH₂(OCH₂CH₂)_nOCH₂Y (IV) dans laquelle n est un nombre entier compris entre 2 et 20, de préférence entre 3 et 10. X représente H₂N- ou H₂N- substitué qui est transformable en H₂N-, de préférence par hydrolyse ou réduction. Y représente un carboxy ou un groupe qui est transformable en carboxy.

IPC 1-7

A61K 39/385; A61K 39/44; C07C 217/08; C07D 209/48; C07K 3/08; C07K 17/06; G01N 33/53

IPC 8 full level

A61K 38/00 (2006.01); **A61K 38/22** (2006.01); **A61K 38/36** (2006.01); **A61K 39/395** (2006.01); **A61K 47/48** (2006.01); **A61K 49/00** (2006.01); **C07C 43/178** (2006.01); **C07C 69/708** (2006.01); **C07C 205/14** (2006.01); **C07C 217/08** (2006.01); **C07C 233/18** (2006.01); **C07C 235/06** (2006.01); **C07C 271/16** (2006.01); **C07D 207/46** (2006.01); **C07D 209/48** (2006.01); **C07D 243/32** (2006.01); **C07K 16/00** (2006.01); **C07K 16/28** (2006.01); **C07K 16/44** (2006.01); **C07K 17/06** (2006.01); **C07K 19/00** (2006.01); **G01N 33/532** (2006.01); **G01N 33/547** (2006.01)

CPC (source: EP)

A61K 47/60 (2017.07); **A61K 47/61** (2017.07); **A61K 47/6829** (2017.07); **A61K 47/6889** (2017.07); **C07C 43/178** (2013.01); **C07C 43/1785** (2013.01); **C07C 43/1787** (2013.01); **C07C 69/708** (2013.01); **C07C 217/08** (2013.01); **C07C 233/18** (2013.01); **C07C 271/16** (2013.01); **C07D 207/46** (2013.01); **C07D 209/48** (2013.01); **C07K 16/28** (2013.01); **C07K 16/44** (2013.01); **A61K 2039/505** (2013.01); **A61K 2039/6037** (2013.01); **A61K 2039/6068** (2013.01); **A61K 2039/627** (2013.01)

Citation (search report)

See references of WO 9201474A1

Designated contracting state (EPC)

AT BE CH DE DK ES FR GB GR IT LI LU NL SE

DOCDB simple family (publication)

WO 9201474 A1 19920206; AU 657483 B2 19950316; AU 8239491 A 19920218; CA 2087163 A1 19920121; EP 0540612 A1 19930512; IE 912556 A1 19920129; JP H06500077 A 19940106; PT 98395 A 19920630

DOCDB simple family (application)

SE 9100497 W 19910716; AU 8239491 A 19910716; CA 2087163 A 19910716; EP 91913626 A 19910716; IE 255691 A 19910719; JP 51259091 A 19910716; PT 9839591 A 19910719